

(12) DEMANDE INTERNATIONALE PUBLIÉE EN VERTU DU TRAITÉ DE COOPÉRATION  
EN MATIÈRE DE BREVETS (PCT)(19) Organisation Mondiale de la Propriété  
Intellectuelle  
Bureau international

PUBLISHED BY THE WORLD INTELLECTUAL PROPERTY ORGANIZATION

(43) Date de la publication internationale  
23 mai 2002 (23.05.2002)

PCT

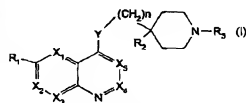
(10) Numéro de publication internationale  
WO 02/40474 A2(51) Classification internationale des brevets :  
C07D 409/14, 401/06,  
401/14, 417/14, A61K 31/47, A61P 31/04(21) Numéro de la demande internationale :  
PCT/FR01/03559(22) Date de dépôt international :  
14 novembre 2001 (14.11.2001)

(25) Langue de dépôt : français

(26) Langue de publication : français

(30) Données relatives à la priorité :  
00/14738 15 novembre 2000 (15.11.2000) FR(71) Déposant : AVENTIS PHARMA S.A. (FR/FR); 20 av.  
venue Raymond Aron, F-92160 ANTONY (FR).(72) Inventeurs : BACQUÉ, Eric; 123 allée de la Claire-  
ière, F-91190 GIF SUR YVETTE (FR). CARRY,  
Jean-Christophe; 41 rue du Dauphiné, F-94100 SAINT  
MAUR DES FOSSES (FR). EL-AHMAD, Youssef; 11  
avenue de Verdun, F-94000 CRETEIL (FR). EVERS,  
Michel; 8 rue Robert Schumann, F-94510 LA QUEUE ENBRIE (FR). HUBERT, Philippe; 22 rue Georges Guime,  
F-94700 MAISONS-ALFORT (FR). MALLERON,  
Jean-Luc; 2 allée Renoir, F-91460 MARCOUSSIS (FR).  
MIGNANI, Serge; 14 avenue de Robinson, F-92290  
CHATENAY-MALABRY (FR). PANTEL, Guy; 12 rue  
Jean-Baptiste Clément, F-94510 LA QUEUE EN BRIE  
(FR). TABART, Michel; 3 rue Paul Langevin, F-91290  
LA NORVILLE (FR). VIVIANI, Fabrice; 46 rue Jules  
Fossier, F-95380 LOUVRES (FR).(74) Mandataire : LOBJOIS, Françoise; AVENTIS  
PHARMA S.A., Direction Brevets, 20 avenue Ray-  
mond Aron, F-92160 ANTONY CEDEX (FR).(81) États désignés (national) : AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ,  
BA, BB, BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ,  
DE, DK, DM, DZ, EC, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM,  
HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KR, KZ, LC, LK,  
LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX,  
MZ, NO, NZ, OM, PH, PL, PT, RO, RU, SD, SE, SG, SI,  
SK, SL, TJ, TM, TR, TT, TZ, UA, UG, UZ, VN, YU, ZA,  
ZW.(84) États désignés (régional) : brevet ARIPO (GH, GM, KE,  
LS, MW, MD, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZW), brevet eurasion  
(AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), brevet européen  
(AT, BE, CH, CY, DE, DK, ES, FI, GB, GR, IE, IT, LU,

[Suite sur la page suivante]

(54) Title: HETEROCYCLYLALKYL PIPERIDINE DERIVATIVES, THEIR PREPARATION AND COMPOSITIONS  
CONTAINING SAME(54) Titre: DERIVES HETEROCYCLYLALCOYL PIPERIDINE, LEUR PREPARATION ET LES COMPOSITIONS QUI LES  
CONTIENNENT

(57) Abstract: The invention concerns heterocyclylalkyl piperidine derivatives of general formula (I), wherein  $X_1, X_2, X_3, X_4$  and  $X_5$  are  $>C-R^1$ ,  $>C-R^2$ , or one at most represents  $N$ ;  $R_2$  is  $COOH$ , alkoxycarbonyl, cycloalkoxycarbonyl,  $CN$ ,  $-CONR^2R^3$  or  $R_2$  is  $CH_2OH$ , alkyl substituted or  $R_2$  is  $-CF_2-R^2$ ,  $-C(CH_3)_2-R^2$ ,  $-CO-R^2$ ,  $-CHOH-R^2$ ,  $-C(cycloalkyl)-R^2$  or  $-CH=CH-R^2$ ;  $R_3$  is phenyl, heterocyclyl, alk- $R^3$ ;  $Y$  represents  $-CH-R^4$  or a difluoromethylene, carbonyl, hydroxyiminomethylene, alkoxyliminomethylene, cycloalkoxyiminomethylene radical, or a cycloalkylene-1,1 radical;

and  $n = 0$  to 4 provided that the radicals or phenyl or heterocyclyl portions mentioned above can optionally be substituted, in the enantiomeric or diastereoisomeric forms or mixtures thereof, and/or as the case may be in their syn or anti form or mixture thereof and their salts.

(57) Abrégé : Dérivés hétérocyclylalkyl piperidine de formule générale (I) pour lesquels:  $X_1, X_2, X_3, X_4$  et  $X_5$  sont  $>C-R^1$ ,  $>C-R^2$ , ou bien l'un au plus représente  $N$ ;  $R_2$  est  $COOH$ , alcoyloxycarbonyl, cycloalcoyloxycarbonyl,  $CN$ ,  $-CONR^2R^3$  ou  $R_2$  est  $CH_2OH$ , alcoyle substitué ou  $R_2$  est  $-CF_2-R^2$ ,  $-C(CH_3)_2-R^2$ ,  $-CO-R^2$ ,  $-CHOH-R^2$ ,  $-C(cycloalcoyle)-R^2$  ou  $-CH=CH-R^2$ ;  $R_3$  est phényle, hétérocyclyle, alk- $R^3$ ;  $Y$  représente  $-CH-R^4$  ou un radical difluorométhylène, carbonyle, hydroxyiminométhylène, alcoyloximinométhylène, cycloalcoyloximinométhylène, ou un radical cycloalcoylène-1,1, et  $n = 0$  à 4 étant entendu que les radicaux ou portions phényle ou hétérocyclyle mentionnés ci-dessus peuvent être éventuellement substitués, sous leurs formes énantiomères ou diastérotisomères ou les mélanges de ces formes, et/ou le cas échéant sous leur forme syn ou anti ou leur mélange ainsi que leurs sels.

WO 02/40474 A2